

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局



(43) 国際公開日  
2004年3月25日 (25.03.2004)

PCT

(10) 国際公開番号  
WO 2004/024143 A1

- (51) 国際特許分類<sup>7</sup>: A61K 31/40, A61P 1/14, C07D 207/08
- (21) 国際出願番号: PCT/JP2002/009390
- (22) 国際出願日: 2002年9月12日 (12.09.2002)
- (25) 国際出願の言語: 日本語
- (26) 国際公開の言語: 日本語
- (71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): ナガセケムテックス株式会社 (NAGASE CHEMTEX CORPORATION) [JP/JP]; 〒550-8668 大阪府 大阪市 西区 新町 1丁目 1番 17号 Osaka (JP).
- (72) 発明者; および
- (75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 北島 昭彦 (KI-TAJIMA, Akihiko) [JP/JP]; 〒664-0898 兵庫県 伊丹市 千僧 5-4 1 ナガセケムテックス株式会社 伊丹工場内 Hyogo (JP). 加守田 修 (KAMODA, Osamu) [JP/JP]; 〒664-0898 兵庫県 伊丹市 千僧 5-4 1 ナガセケムテックス株式会社 伊丹工場内 Hyogo (JP). 大迫 秋広 (OHSAKO, Akihiro) [JP/JP]; 〒664-0898 兵庫県 伊丹市 千僧 5-4 1 ナガセケムテックス株式会社 伊丹工場内 Hyogo (JP). 柳 利治 (YANAGI, Toshiharu) [JP/JP]; 〒664-0898 兵庫県 伊丹市 千僧 5-4 1 ナガセケムテックス株式会社 伊丹工場内 Hyogo (JP).
- (74) 代理人: 岩谷 龍 (IWATANI, Ryo); 〒530-0003 大阪府 大阪市 北区 堂島 2丁目 1番 27号 桜橋千代田ビル 5階 Osaka (JP).
- (81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AU, AZ, BA, BB, BR, BY, BZ, CA, CN, CO, CR, CU, DM, DZ, EC, GD, GE, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LT, LV,

/続葉有/

(54) Title: MEDICINAL COMPOSITION

(54) 発明の名称: 医薬組成物

(57) Abstract: An ameliorant for improving the movement of the digestive tract which is rich in binding affinity for a serotonin receptor 4 (5HT<sub>4</sub>), causes no disorders such as arteritis and thrombus formation, and contains as an active ingredient 4-amino-5-chloro-2-methoxy-N-[(2S,4S)-2-hydroxymethyl-4-pyrrolidinyl]benzamide or an acid addition salt thereof, which is a product of metabolism of 4-amino-5-chloro-2-methoxy-N-[(2S,4S)-1-ethyl-2-hydroxymethyl-4-pyrrolidinyl]benzamide or an acid addition salt thereof; a medicinal composition for improving the movement of the digestive tract which comprises the ameliorant and a pharmaceutically acceptable support, is rich in binding affinity for a serotonin receptor 4 (5HT<sub>4</sub>), and causes no disorders such as arteritis and thrombus formation; and a treatment for enhancing the movement of the digestive tract which comprises using the medicinal composition.

(57) 要約:

本願発明は、セロトニン受容体4 (5HT<sub>4</sub>) に対する結合親和性に富み、動脈炎、血栓形成等の発症が起こらない、4-アミノ-5-クロロ-2-メトキシ-N-[(2S, 4S)-1-エチル-2-ヒドロキシメチル-4-ピロリジニル] ベンズアミド又はその酸付加塩の代謝物である4-アミノ-5-クロロ-2-メトキシ-N-[(2S, 4S)-2-ヒドロキシメチル-4-ピロリジニル] ベンズアミド又はその酸付加塩を有効成分とする消化管運動機能改善剤又は当該改善剤と製薬上許容される担体とからなるセロトニン受容体4 (5HT<sub>4</sub>) に対する結合親和性に富み、動脈炎、血栓形成等の発症が起こらない消化管運動機能改善医薬組成物或いは当該消化管運動機能改善医薬組成物を使用する消化管運動機能亢進のための治療を提供する。



MA, MD, MG, MK, MN, MX, NO, NZ, OM, PH, PL, RO, RU, SG, SI, TJ, TM, TN, TT, UA, US, UZ, VC, VN, YU, ZA.

- (84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, SK, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

規則4.17に規定する申立て:

- AE, AG, AL, AM, AU, AZ, BA, BB, BR, BY, BZ, CA, CN, CO, CR, CU, DM, DZ, EC, GE, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LT, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MX, NO, NZ, OM, PH, PL, RO, RU, SG, SI, TJ, TM, TN, TT, UA, UZ, VC, VN, YU, ZA, ARIPO 特許 (GH, GM, KE,

LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, SK, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG)の指定のための出願し及び特許を与えられる出願人の資格に関する申立て (規則4.17(ii))  
— USのための発明者である旨の申立て (規則4.17(iv))

添付公開書類:

- 国際調査報告書  
— 補正書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。